

[Japan. J. Pharmacol., 29, 9 (1979)]

Species Difference and Characterization of Intestinal Esterase on the Hydrolizing Activity of Ester-Type Drugs

MICHIKO INOUE*, MASAKO MORIKAWA*, MINORU TSUBOI*,
MAMORU SUGIURA

エステル型薬物の加水分解における小腸エステラーゼの種特異性

井上みち子*, 森川正子*, 坪井 実*, 杉浦 衛

エステル型薬物の吸収における小腸エステラーゼの役割について研究した。ラットに高脂肪餌を与えた結果、小腸エステラーゼ活性は増加し、低脂肪餌では逆に活性が低下した。また、小腸エステラーゼは肝臓薬物代謝酵素において観察されるようなフェノバルビタールによる酵素の誘導は起らなかった。ヒト小腸エステラーゼとラット、マウス、ウサギ、モルモット、イヌのエステラーゼとの比較を行なった結果、Fig I に示すように酵素の電気泳動的パターンが大きく異なることが明らかになり、エステル型薬物 aspirin, indanylcarbenicillin, clofibrate ならびにエステラーゼ基質を用いた場合、エステラーゼによってよく水解されることが判明した。そこでラット反転腸管を用い indanylcarbenicillin の吸収実験を行なったところ、エステル型の方が、より吸収されるとの知見が得られた。

したがってエステル型薬物の吸収時において小腸粘膜エステラーゼが重要な役割を果していることが強く示唆された。

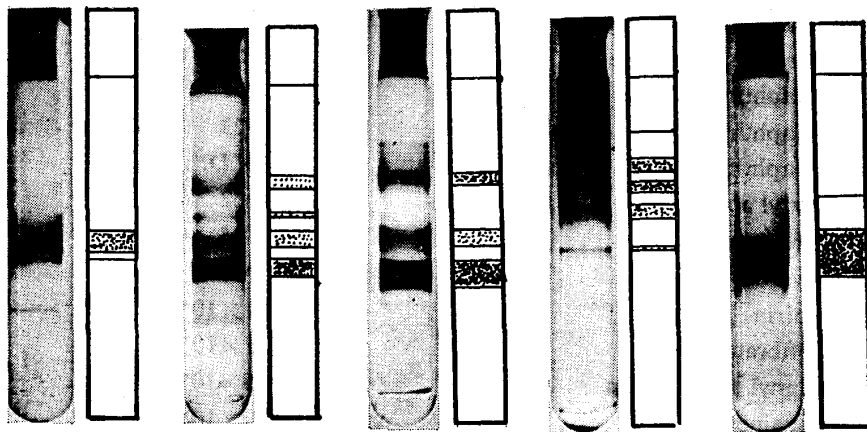


FIG. I. Disc electrophoretic pattern of esterase activity from human, rat, mouse, guinea pig and rabbit intestine 200 μ g of protein were applied to each gel. 7.5% polyacrylamide gel was used and the disc electrophoresis was carried out at 4° for 70 min. Staining was carried out using β -naphthyl acetate-Fast Blue B.